

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2005年6月30日 (30.06.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/058866 A1(51) 国際特許分類⁷:
A61K 31/381 // C07B 61/00

C07D 333/22,

(74) 代理人: 三枝 英二, 外(SAEGUSA, Eiji et al.); 〒5410045 大阪府大阪市中央区道修町 1-7-1 北浜TNKビル Osaka (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/018569

(22) 国際出願日: 2004年12月13日 (13.12.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

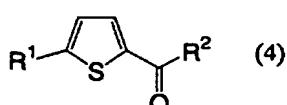
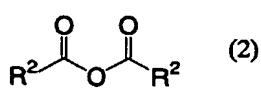
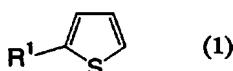
(30) 優先権データ:
特願 2003-419362
2003年12月17日 (17.12.2003) JP

(71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): 住友精化株式会社 (SUMITOMO SEIKA CHEMICALS CO., LTD.) [JP/JP]; 〒6750145 兵庫県加古郡播磨町宮西 346番地の1 Hyogo (JP).

(72) 発明者: および
(75) 発明者/出願人(米国についてのみ): 坂東 誠二 (BANDO, Seiji) [JP/JP]; 〒6750145 兵庫県加古郡播磨町宮西 346番地の1 住友精化株式会社 精密化学品研究所内 Hyogo (JP). 佐竹 秀三 (SATAKE, Syuzo) [JP/JP]; 〒6750145 兵庫県加古郡播磨町宮西 346番地の1 住友精化株式会社 精密化学品研究所内 Hyogo (JP). 加賀野 宏和 (KAGANO, Hirokazu) [JP/JP]; 〒6750145 兵庫県加古郡播磨町宮西 346番地の1 住友精化株式会社 精密化学品研究所内 Hyogo (JP).

(54) Title: PROCESS FOR PRODUCING 2-ACYLTHIOPHENE COMPOUND

(54) 発明の名称: 2-アシルチオフェン化合物の製造方法



(57) Abstract: A process for producing a 2-acylthiophene compound reduced in the content of the 3-acyl isomer generated as a by-product. The process, which is for producing a 2-acylthiophene compound represented by the general formula (4): [Chemical formula 4] (4) (wherein R¹ represents hydrogen, C₁₋₆ alkyl, phenyl, or halogeno and R² represents C₁₋₆ alkyl or phenyl), is characterized by reacting a thiophene compound represented by the general formula (1): [Chemical formula 1] (1) (wherein R¹ is the same as defined above) with at least one member selected from the group consisting of acid anhydrides represented by the general formula (2): [Chemical formula 2] (2) (wherein R² is the same as defined above) and acid halides represented by the general formula (3): [Chemical formula 3] (3) (wherein R² is the same as defined above and X represents halogeno) in the presence of a solid acid catalyst at a temperature lower than 75°C in the absence of any solvent.

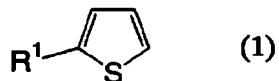


(57) 要約:

副反応生成物である3位異性体の含有量の少ない2-アシルチオフェン化合物の製造方法を提供する。

本発明は、一般式(1)；

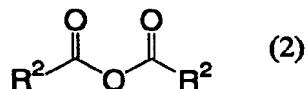
[化1]



(式中、R¹は水素原子、炭素数1ー6のアルキル基、フェニル基またはハロゲン原子を示す。)

で表されるチオフェン化合物と、一般式(2)；

[化2]



(式中、R²は炭素数1ー6のアルキル基またはフェニル基を示す。)で表される酸無水物および

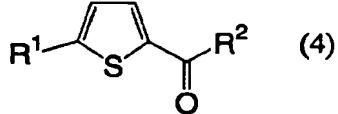
一般式(3)；

[化3]



(式中、R²は前記と同様であり、Xはハロゲン原子を示す。)で表される酸ハロゲン化物からなる群より選択される少なくとも1種とを、固体酸触媒の存在下で、75°C未満、無溶媒で反応させることを特徴とする一般式(4)；

[化4]



(式中、R¹およびR²は前記と同様である。)で表される2-アシルチオフェン化合物の製造方法を提供する。